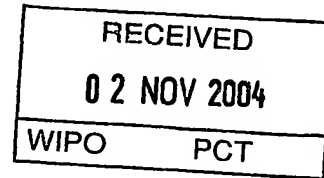


**BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**

**PRIORITY  
DOCUMENT**  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung**

**Aktenzeichen:**

103 49 498.7

**Anmeldetag:**

23. Oktober 2003

**Anmelder/Inhaber:**

Bayer CropScience Aktiengesellschaft,  
40789 Monheim/DE

**Bezeichnung:**

Isopentylcarboxanilide

**IPC:**

C 07 D, C 07 C, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.**

München, den 23. Juli 2004  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
Der Präsident  
Im Auftrag

Stremme

Isopentylcarboxanilide

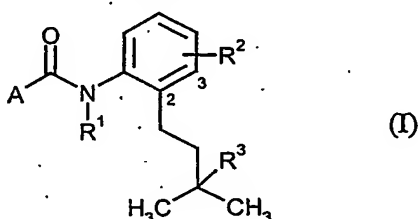
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Isopentylcarboxanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxanilide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 02/059086, WO 00/09482, EP-A 0 824 099, EP-A 0 755 927, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, JP 11-335364, JP 10-310577 und JP 10-251240). So sind beispielsweise 1-Methyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (aus EP-A 0 824 099) und 2,5-Dimethyl-N-[3-(3-methylbutyl)phenyl]-3-furamid aus (EP-A 0 755 927) bekannt. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

10

Es wurden nun neue Isopentylcarboxanilide der Formel (I)



15

gefunden, in welcher

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl,

(Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

20

25

R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

30

R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

$R^5$  und  $R^6$  unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

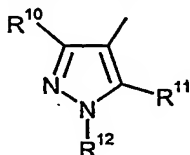
$R^5$  und  $R^6$  außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfachen oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder  $NR^9$  enthalten kann,

$R^7$  und  $R^8$  unabhängig voneinander für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

$R^7$  und  $R^8$  außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfachen oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder  $NR^9$  enthalten kann,

$R^9$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

$R^{10}$  für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl- $C_1$ - $C_4$ -alkyl steht,

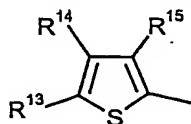
$R^{11}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und

$R^{12}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Hydroxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht,

mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Iod steht, wenn  $R^{11}$  für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn  $R^3$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff und  $R^{12}$  für Methyl stehen,

oder

5 A für den Rest der Formel (A2)



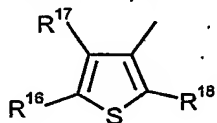
(A2) steht, in welcher

$R^{13}$  und  $R^{14}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

$R^{15}$  für Halogen, Cyano oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

10 A für den Rest der Formel (A3)



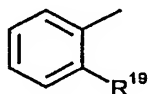
(A3) steht, in welcher

$R^{16}$  und  $R^{17}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

$R^{18}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15 A für den Rest der Formel (A4)

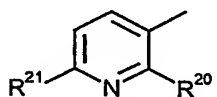


(A4) steht, in welcher

20  $R^{19}$  für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



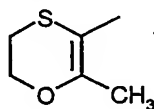
(A5) steht, in welcher

25  $R^{20}$  für Halogen, Hydroxy, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{21}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl steht,

oder

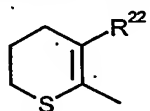
5 A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

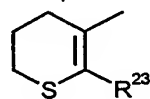


(A7) steht, in welcher

10  $R^{22}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

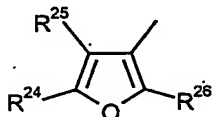


(A8) steht, in welcher

$R^{23}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15 oder

A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht, in welcher

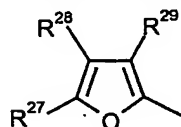
$R^{24}$  und  $R^{25}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

20  $R^{26}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass  $R^{24}$  und  $R^{26}$  nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn  $R^{25}$  für Wasserstoff steht,

oder

25 A für den Rest der Formel (A10)



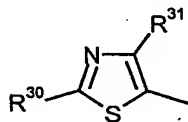
(A10) steht, in welcher

$R^{27}$  und  $R^{28}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

$R^{29}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit bis 5 Halogenatomen steht,

oder

5 A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

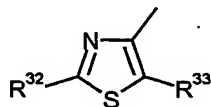
$R^{30}$  für Wasserstoff, Halogen, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino, Di-( $C_1$ - $C_4$ -alkyl)amino, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{31}$  für Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass  $R^{31}$  nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn  $R^3$  für Wasserstoff und  $R^{30}$  für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



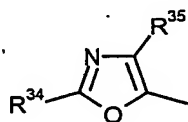
(A12) steht, in welcher

$R^{32}$  für Wasserstoff, Halogen, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino, Di-( $C_1$ - $C_4$ -alkyl)amino, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{33}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

20 A für den Rest der Formel (A13)



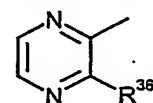
(A13) steht, in welcher

$R^{34}$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht und

$R^{35}$  für Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

oder

25 A für den Rest der Formel (A14)

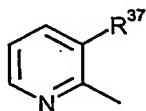


(A14) steht, in welcher

$R^{36}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

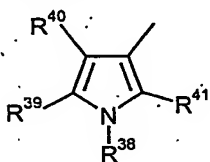


(A15) steht, in welcher

R<sup>37</sup> für Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)



(A16) steht, in welcher

R<sup>38</sup> für Wasserstoff, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

R<sup>39</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

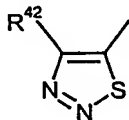
R<sup>40</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>41</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R<sup>40</sup> nicht für Trifluormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)



(A17) steht, in welcher

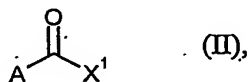
R<sup>42</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl

die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) erhält, indem man

- 5 a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

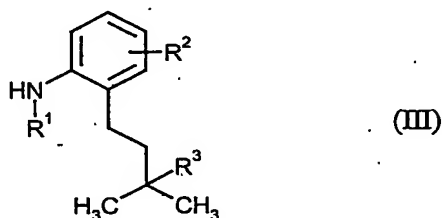


in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X<sup>1</sup> für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)

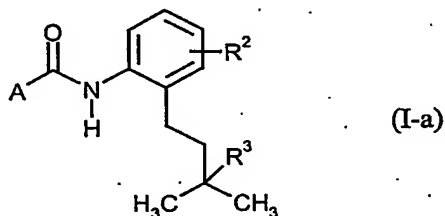


in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

- b) Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)



in welcher A, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben  
mit Halogeniden der Formel (IV)



in welcher

X<sup>2</sup> für Chlor, Brom oder Iod steht,

R<sup>1-A</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,



C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenycycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder

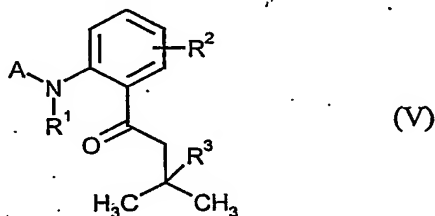
-C(=O)C(=O)R<sup>4</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> steht,

wobei R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

c) Isopenten-Derivate der Formel (V)

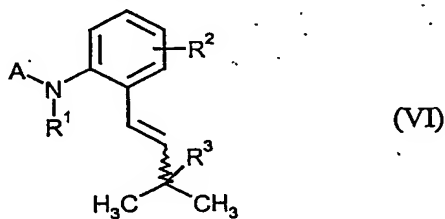


in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)

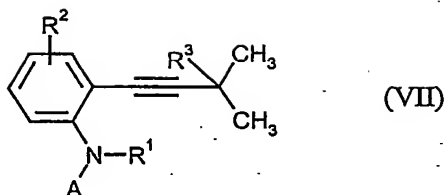


in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)



in welcher  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

5

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

10. Die erfindungsgemäßen Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

- 15  $R^1$  steht bevorzugt für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_3$ -alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $(C_1$ - $C_3$ -Alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $(C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl; Halogen- $(C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, Halogen- $(C_1$ - $C_3$ -alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- ( $C_1$ - $C_6$ -Alkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy)carbonyl,  $(C_1$ - $C_3$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl)carbonyl;  $(C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl)carbonyl,  $(C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- $C_1$ - $C_3$ -alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_6$ -Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder  $-C(=O)C(=O)R^4$ ,  $-CONR^5R^6$  oder  $-CH_2NR^7R^8$ .

25

- $R^1$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluorme-

30

thylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl,  $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ;

Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder  $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{CONR}^6\text{R}^7$  oder  $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ .

$\text{R}^1$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl,  $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ .

$\text{R}^2$  steht bevorzugt für Wasserstoff.

$\text{R}^2$  steht außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

$\text{R}^2$  steht außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

$\text{R}^2$  steht außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

$\text{R}^2$  steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

$\text{R}^3$  steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod,  $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Halogenalkyl}$  mit 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

$\text{R}^3$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec-, tert-Butyl oder  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}$  mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

$\text{R}^3$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl.

R<sup>4</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluor-methoxy.

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>9</sup> enthalten kann.

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R<sup>9</sup> substituiert sein kann.

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>9</sup> enthalten kann.

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl,

Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R<sup>9</sup> substituiert sein kann.

R<sup>9</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.

10 R<sup>9</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

A steht bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste  
A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.

15 A steht besonders bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste  
A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.

A steht ganz besonders bevorzugt für den Rest A1.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2.

20 A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A11.

25 A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A12.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A13.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A14.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16.

30 R<sup>10</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl

mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Iod steht, wenn  $R^{11}$  für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn  $R^3$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff und  $R^{12}$  für Methyl stehen.

$R^{10}$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Pentafluorethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio,

mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Iod steht, wenn  $R^{11}$  für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn  $R^3$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff und  $R^{12}$  für Methyl stehen.

$R^{10}$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, -CHFCH<sub>3</sub> oder Difluormethoxy,

mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Iod steht, wenn  $R^{11}$  für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn  $R^3$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff und  $R^{12}$  für Methyl stehen.

$R^{10}$  steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, -CHFCH<sub>3</sub> oder Difluormethoxy,

mit der Maßgabe, dass  $R^{10}$  nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn  $R^3$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff und  $R^{12}$  für Methyl stehen.

$R^{11}$  steht bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,

$R^{11}$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder -CHFCH<sub>3</sub>.

$R^{11}$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Methyl oder -CHFCH<sub>3</sub>.

$R^{12}$  steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.

$R^{12}$  steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.

$R^{12}$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

$R^{12}$  steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

- R<sup>13</sup> und R<sup>14</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>13</sup> und R<sup>14</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R<sup>13</sup> und R<sup>14</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>13</sup> und R<sup>14</sup> stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- 10 R<sup>15</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>15</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.
- R<sup>15</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder
- 15 Trifluormethoxy.
- R<sup>15</sup> steht insbesondere bevorzugt für Chlor oder Methyl.
- R<sup>16</sup> und R<sup>17</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R<sup>16</sup> und R<sup>17</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>16</sup> und R<sup>17</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.
- 25 R<sup>16</sup> und R<sup>17</sup> stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- R<sup>18</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>18</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl.
- 30 R<sup>18</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.
- R<sup>19</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R<sup>19</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl,

Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.

R<sup>19</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R<sup>19</sup> steht insbesondere bevorzugt für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.

R<sup>20</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R<sup>20</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R<sup>20</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R<sup>21</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylsulfonyl.

R<sup>21</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

R<sup>21</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

R<sup>21</sup> steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.

R<sup>22</sup> steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R<sup>22</sup> steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R<sup>22</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.



- R<sup>23</sup> steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>23</sup> steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R<sup>23</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 10 R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.
- 15 R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- R<sup>26</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>26</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R<sup>26</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>26</sup> steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.
- 25 R<sup>27</sup> und R<sup>28</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>27</sup> und R<sup>28</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R<sup>27</sup> und R<sup>28</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>27</sup> und R<sup>28</sup> stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- 35 R<sup>29</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- R<sup>29</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>29</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R<sup>29</sup> steht insbesondere bevorzugt für Methyl.
- R<sup>30</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 10 R<sup>30</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>30</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 15 R<sup>30</sup> steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>31</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R<sup>31</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>31</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Methoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 25 R<sup>31</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Methoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>32</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 30 R<sup>32</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>32</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 35 R<sup>32</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

- R<sup>32</sup> steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- 5 R<sup>33</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>33</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>33</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R<sup>33</sup> steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
- R<sup>34</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
- R<sup>34</sup> steht besonders bevorzugt für Methyl.
- 15 R<sup>35</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl,
- R<sup>35</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor oder Methyl.
- R<sup>36</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R<sup>36</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>37</sup> steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 25 R<sup>37</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl.
- R<sup>37</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R<sup>38</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.
- R<sup>38</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.
- 35 R<sup>38</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.

- R<sup>39</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R<sup>39</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R<sup>39</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R<sup>40</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R<sup>40</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R<sup>40</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>41</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 15 R<sup>41</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>41</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Trifluormethyl.
- R<sup>42</sup> steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.
- 20 R<sup>42</sup> steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup> für Formyl steht.

- Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I), in welcher R<sup>4</sup> für  $-C(=O)C(=O)R^5$  steht, wobei R<sup>5</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat.
- 25

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher A für A1 steht.

- Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.
- 30

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

- Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert.
- 35 Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

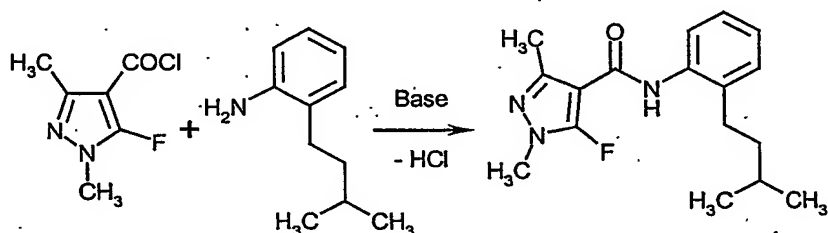
Die genannten Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Definitionen entfallen.

Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), welche jeweils die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

**Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte**

**Verfahren (a)**

Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und [2-(3-Methylbutyl)-phenyl]amin als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. X<sup>1</sup> steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

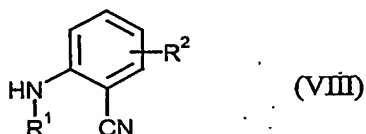
Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R<sup>1</sup>,

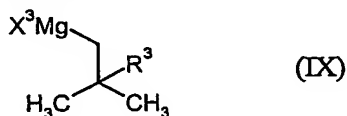
$R^2$  und  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind teilweise neu. Anilin-Derivate der Formel (III) lassen sich herstellen, indem man,

f) Cyanoaniline der Formel (VIII)



in welcher  $R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, in einem ersten Schritt mit einem Grignard-Reagenz der Formel (IX)

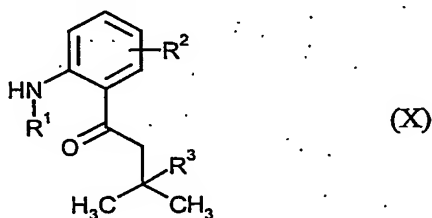


in welcher

$R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

$X^3$  für Chlor, Brom oder Iod steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die so erhaltenen Alkanonaniline der Formel (X)



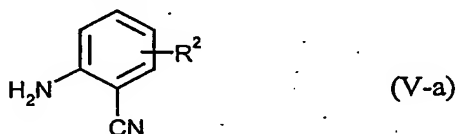
in welcher  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in einem zweiten Schritt mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base (z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

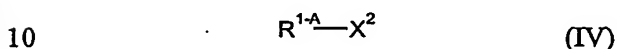
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Cyanoaniline sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben  $R^1$  und  $R^2$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits

im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

- Die Cyanoaniline der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen. Cyanoaniline der Formel (VIII), in welcher  $R^1$  nicht für Wasserstoff steht, können erhalten werden, indem man Cyanoaniline der Formel (V-a)



in welcher  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen hat, mit Halogeniden der Formel (IV)



in welcher  $R^{1-A}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

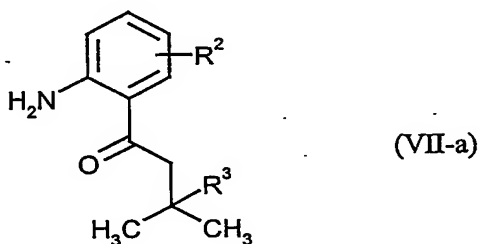
- 15 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Grignard-Reagenzien sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) hat  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.
- 20  $X^3$  steht bevorzugt für Brom.

Die Grignard-Reagenzien der Formel (IX) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.

- 25 Die Alkanonaniline der Formel (X), die im erfindungsgemäßen Verfahren (f) als Zwischenprodukte durchlaufen werden sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. In der Formel (X) haben die Reste  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.
- 30

Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat), welches ebenfalls als Reagenz im erfindungsgemäßen Verfahren (f) benötigt wird, ist eine bekannte Syntheschemikalie.

Das erfindungsgemäße Verfahren (f) kann in verschiedenen Varianten durchgeführt werden. So ist es möglich, zunächst Cyanoaniline der Formel (V-a) zu den entsprechenden Alkanonanilinen der Formel (VII-a)



in welcher  $R^2$  und  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)

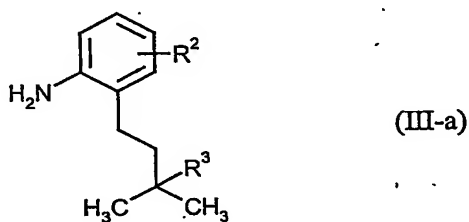


in welcher  $R^{1-A}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

- 10 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden Alkanonaniline der Formel (X) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

Es ist jedoch auch möglich, die Alkanonaniline der Formel (VII-a) gemäß dem erfindungsgemäßen

- 15 Verfahren (f) zu den entsprechenden Anilin-Derivaten der Formel (III-a)



in welcher  $R^2$  und  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)

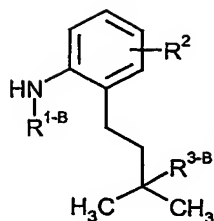


- 20 in welcher  $R^{1-A}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden Anilin-Derivaten der Formel (III) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

- 25 Anilin-Derivate der Formel (III-b)





(III-b)

in welcher

a)  $R^{1-B}$  für  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl; Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

( $C_1$ - $C_8$ -Alkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy)carbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl)carbonyl; ( $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl)carbonyl; ( $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder  $-C(=O)C(=O)R^4$ ,  $CONR^5R^6$  oder  $-CH_2NR^7R^8$  steht, und

$R^{3-B}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl steht,

oder

b)  $R^{1-B}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl; Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

( $C_1$ - $C_8$ -Alkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy)carbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl)carbonyl; ( $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_8$ -Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder  $-C(=O)C(=O)R^4$ ,  $CONR^5R^6$  oder  $-CH_2NR^7R^8$  steht, und

$R^{3-B}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl steht,

und

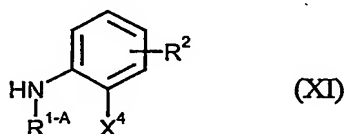
$R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  und  $R^8$  jeweils die oben angegebenen Bedeutungen haben, sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung.

Die bevorzugten, besonders bevorzugten bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von  $R^1$  und  $R^3$  finden auf  $R^{1-B}$  und  $R^{3-B}$  entsprechend Anwendung, wobei im Fall a)  $R^{1-B}$  jeweils nicht für Wasserstoff steht und im Fall b)  $R^{3-B}$  nicht für Wasserstoff steht. Die bevorzugten, besonders bevorzugten bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  und  $R^8$  gelten ebenfalls für die neuen Verbindungen der Formel (III-b).

- 10 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (III-b), in welcher  $R^1$  und  $R^2$  jeweils für Wasserstoff und  $R^3$  für Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl oder Pentafluorethyl steht.

Anilin-Derivate der Formel (III) werden außerdem erhalten, indem man

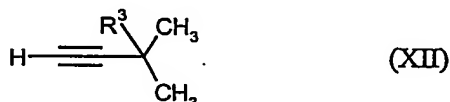
g) Anilinhalogenide der Formel (XI)



in welcher

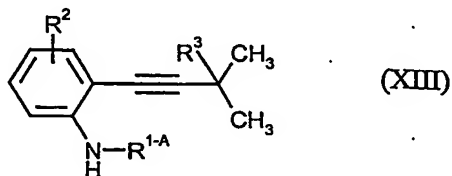
$R^{1-A}$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und  $X^4$  für Halogen steht,

in einem ersten Schritt mit Alkinen der Formel (XII)



in welcher  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und in einem zweiten Schritt die so erhaltenen Alkinaniline der Formel (XIII)



in welcher  $R^{1-A}$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Anilinhalogenide sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) hat  $R^2$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.  $R^{1-A}$  hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.

- 10 Die Anilinhalogenide der Formel (XI) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren, z.B. aus den entsprechenden am Stickstoff unsubstituierten Derivaten durch Umsetzung mit den Halogeniden der Formel (IV), erhalten werden.

- 15 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel (XII) hat  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

- 20 Die Alkine der Formel (XII) sind bekannt.

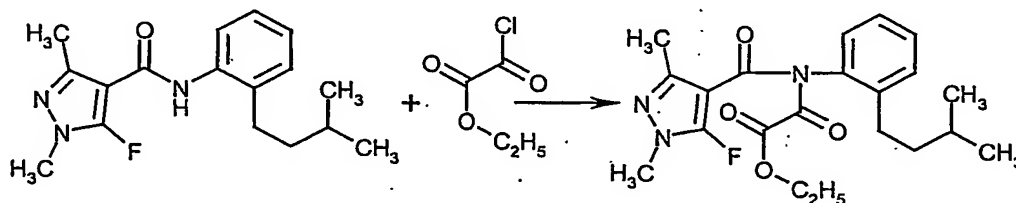
- 25 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Zwischenprodukte durchlaufenden Alkinaniline sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben  $R^2$  und  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.  $R^{1-A}$  hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.

- 30 Die Alkinaniline der Formel (XIII) sind teilweise bekannt. Sie werden nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) erhalten.

- 35 Sollen Anilin-Derivate der Formel (III), in welcher  $R^1$  für Wasserstoff steht, erhalten werden, so wird  $R^{1-A}$  entsprechend ausgewählt, um die Funktion einer Schutzgruppe zu erfüllen, welche im Anschluss an das erfindungsgemäße Verfahren (g) nach üblichen Methoden wieder entfernt werden kann.

**Verfahren (b)**

Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I-a) allgemein definiert. In dieser Formel (I-a) haben  $R^2$ ,  $R^3$  und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. ,

Die Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach einem der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c), (d) oder (e) erhalten werden (mit  $R^1$  = Wasserstoff).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert.

$R^{1-A}$  steht bevorzugt für  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_3$ -alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl; Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, Halogen-( $C_1$ - $C_3$ -alkoxy)carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

( $C_1$ - $C_6$ -Alkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy)carbonyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl)carbonyl; ( $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl)carbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- $C_1$ - $C_3$ -alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl)carbonyl, ( $C_3$ - $C_6$ -Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder  $-C(=O)C(=O)R^4$ ,  $-CONR^5R^6$  oder  $-CH_2NR^7R^8$ .

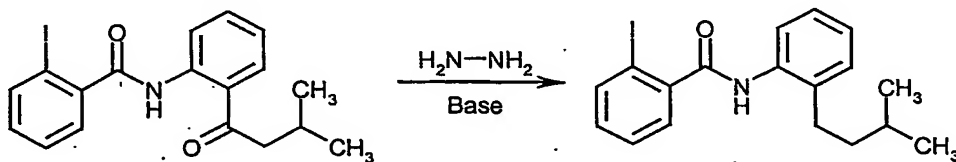
$R^{1-A}$  steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl,

- Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Tri-  
 fluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl,  $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ,  
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_3$ ,  
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ,  
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ,  
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ,  
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ;  
 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,  
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluorme-  
 thylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder  $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{CONR}^6\text{R}^7$  oder  $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ .  
 $\text{R}^{1-\text{A}}$  steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl,  $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ,  
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$ ,  
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ .  
 $\text{X}^2$  steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogenide der Formel (IV) sind bekannt.

#### Verfahren (c)

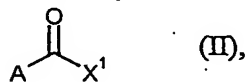
- Verwendet man 2-Iod-N-[2-(3-methylbutanoyl)phenyl]benzamid als Ausgangsstoff, sowie Hydrazin und eine Base so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



- Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Isopenton-  
 Derivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$  und A  
 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im  
 Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevor-  
 zugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopenton-Derivate der Formel (V) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

h) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

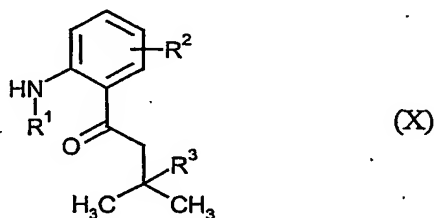


in welcher

5 A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X<sup>1</sup> für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Alkanonanilinen der Formel (X)



in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten

15 Carbonsäure-Derivate der Formel (II) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben.

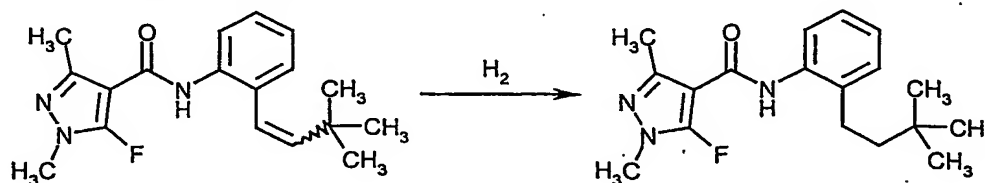
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Alkanonaniline der Formel (X) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen

20 Verfahren (f) beschrieben.

#### Verfahren (d)

Verwendet man N-{2-[3,3-Dimethylbut-1-en-1-yl]phenyl}-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfah-

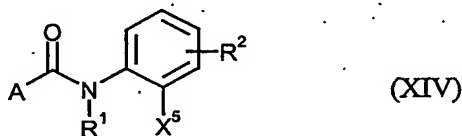
25 rens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Isopenten-Derivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopenten-Derivate der Formel (VI) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

j) Carboxamide der Formel (XIV)

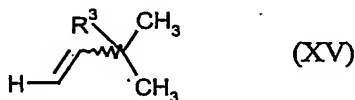


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$X^5$  für Chlor, Brom, Iod oder  $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  steht,

mit Alkenen der Formel (XV)



in welcher  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) haben  $R^1$ ,  $R^2$  und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.  $X^5$  steht bevorzugt für Brom oder  $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ .

Die Carboxamide der Formel (XIV) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. WO 02/08195 und WO 02/08197).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkene sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) hat  $R^3$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusam-

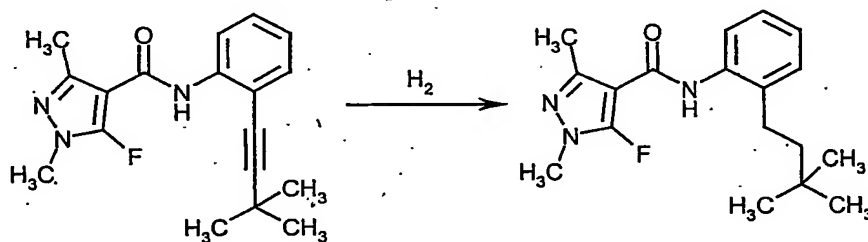
menhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

Die Alkene der Formel (XV) sind bekannt.

5

#### Verfahren (e)

Verwendet man N-[2-(3,3-Dimethylbut-1-in-1-yl)phenyl]-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



10

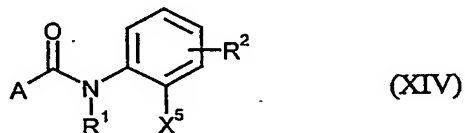
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentin-Derivate sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

15

Die Isopentin-Derivate der Formel (VII), in welcher A nicht für A1 steht, sind neu. Die Isopentin-Derivate der Formel (VII) werden erhalten, indem man

20

k) Carboxamide der Formel (XIV)



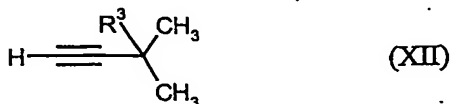
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$X^5$  für Chlor, Brom, Iod oder  $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  steht,

25

mit Alkinen der Formel (XII)



in welcher  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,



in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide der Formel (XIV) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (j) beschrieben worden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine der Formel (XII) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) beschrieben worden.

### Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Ami-

dierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder  
5 Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

10 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und  
15 (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5  
20 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (V) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5  
25 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Alkanonanilin der Formel (X) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlor-  
30 methan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopentylcarboxanilids der Formel (I-a) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (IV) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid infrage.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 100°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 150°C bis 250°C.

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopenton-Derivatives der Formel (V) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Zur Durchführung des zweiten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der  
15 Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Alkanonanilines der Formel (X) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht.

20 Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.  
25

Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die für Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium  
30 oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

Die Hydrierung in den erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie im zweiten Schritt von Verfahren (g) kann statt in Gegenwart von Wasserstoff in Kombination mit einem Katalysator auch in Anwesenheit von Triethylsilan durchgeführt werden.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 100°C.

5

Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0.5 und 200 bar, bevorzugt zwischen 2 und 50 bar, besonders bevorzugt zwischen 3 und 10 bar durchgeführt.

10

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan.

15

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

20

Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der Alkanonaniline der Formel (X) setzt man pro Mol des Cyanoanilines der Formel (VIII) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Grignard-Reagenz der Formel (IX) ein.

25

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan.

30

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat,

35

Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren durchgeführt.

Dazu eignen sich besonders Palladiumsalze oder -komplexe. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium oder Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid infrage. Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand getrennt zur Reaktion zugibt.

Als Liganden kommen vorzugsweise Organophosphorverbindungen infrage. Beispielfhaft seien genannt: Triphenylphosphin, tri-o-Tolylphosphin, 2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl, Dicyclohexylphosphinebiphenyl, 1,4-Bis(diphenylphosphino)butan, Bisdiphenylphosphinoferrocen, Di(tert.-butylphosphino)biphenyl, Di(cyclohexylphosphino)biphenyl, 2-Dicyclohexylphosphino-2'-N,N-dimethylaminobiphenyl, Tricyclohexylphosphin, Tri-tert.-butylphosphin. Es kann aber auch auf Liganden verzichtet werden.

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden ferner gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Metallsalzes, wie Kupfersalzen, beispielsweise Kupfer(I)-iodid durchgeführt.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 50°C bis 150°C.

Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) zur Herstellung der Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Anilinhalogenides der Formel (XI) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Isopenten-Derivate der Formel (VI) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alken der Formel (XV) ein.

- 5 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Isopentin-Derivate der Formel (VII) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

10 Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

15 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

20 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;  
25 Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;  
Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;  
Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;  
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;  
Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder  
30 *Pseudoperonospora cubensis*;  
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;  
Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;  
Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;  
Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;  
35 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;  
Podospaera-Arten, wie beispielsweise *Podospaera leucotricha*;

- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;  
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*  
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*  
5 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;  
Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;  
Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;  
Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;  
10 Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;  
Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;  
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;  
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;  
Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;  
15 Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;  
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;  
Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;  
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;  
Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.  
20
- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.
- 25 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.
- 30 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit  
35 den Wirkstoffen.



Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

- 5     Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

- 10    Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur

- 15    Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wild-  
20    pflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba-  
25    ren oder nicht schützba- ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, bei-  
30    spielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

- 30    Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges  
35    Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,
- Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,
- 25 Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,
- Coniophora, wie *Coniophora puetana*,
- Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
- Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
- Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
- 30 Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
- Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
- Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
- Escherichia, wie *Escherichia coli*,
- Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
- 35 Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

5

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der

10

Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol

15

sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als

20

feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate

25

aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

30

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

35

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und or-

ganische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

**Fungizide:**

15 2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; 20 Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflumentorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; 25 Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafo; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; 30 Furcarbanil; Fumecyclo; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomyacin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuari- 35 mol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin;

Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piper-  
lin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-  
sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyri-  
fenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene;  
5 Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetracon-  
azole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-  
methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamid; Tricyclazole;  
Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A;  
Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-meth-  
10 oxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-  
2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarb-  
oxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid; 3,4,5-Tri-  
chlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cyclo-  
heptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokali-  
15 umcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-  
oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie  
Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb;  
Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

## 20 **Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Othilinin,  
Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere  
Kupfer-Zubereitungen.

## 25 **Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022,  
AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-  
Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflomet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadi-  
rachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus  
30 sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus  
thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria  
bassiana, Beauveria tenella, Benclothiaz, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-  
Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-  
cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofen-  
35 prox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb,  
Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor,

Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlor-  
 dane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluaz-  
 uron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyri-  
 fos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin,  
 5 Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyano-  
 fenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexa-  
 tin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-  
 methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos,  
 Dicofof, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimefluthrin, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dino-  
 buton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439,  
 10 Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora  
 spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole,  
 Etrinfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobu-  
 carb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate,  
 15 Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron,  
 Flubenzimine, Flubrocycrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufen-  
 prox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenazine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formo-  
 thion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-Cyhalothrin,  
 Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801,  
 20 Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidaclo-  
 prid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocab, Isoxathion,  
 Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane,  
 Lufenuron, Malathion, Mecarbarn, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Meth-  
 amidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Metho-  
 25 myl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metofluthrin, Metolcarb, Metoxadiazone,  
 Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-  
 800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Ni-  
 thiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-  
 5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paecilo-  
 30 myces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-  
 6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon,  
 Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Potassi-  
 um oleate, Prallethrin, Profenofos, Profluthrin, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos,  
 Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum,  
 35 Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resme-  
 thrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Sila-

- fluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Trichoderma atroviride, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vanilprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenylpropylcarbammat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO 98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.
- 15 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

- Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.
- 25

- Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.
- 30

- 35 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von

Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens  
5 liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle  
10 biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde  
15 oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder  
20 durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über-  
25 additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife,  
30 höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

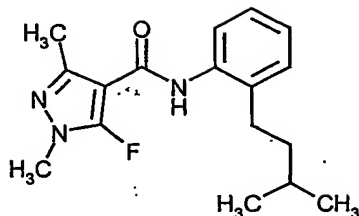
Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen)  
35 Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigen-



schaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

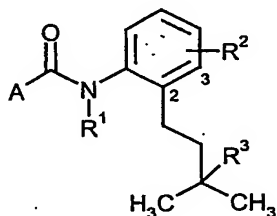
- Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die
- 5 Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

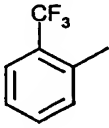
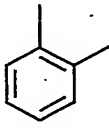
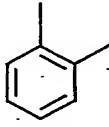
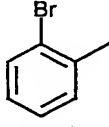
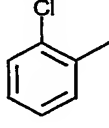
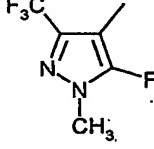
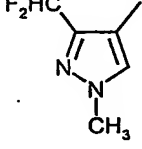
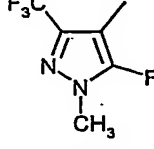
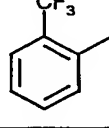
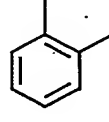
- 5 Zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonylchlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran werden 326.5 mg (2.0 mmol) [2-(3-Methylbutyl)phenyl]amin (III-1) gegeben. Die Reaktionslösung wird 90 min. bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester) liefert 592 mg (98 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.12.

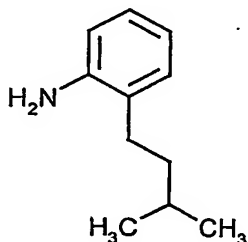
Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

15 Tabelle 1

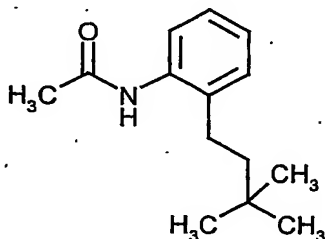
(I)

Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	logP
2	H	H	CH <sub>3</sub>		3.42
3	H	H	CH <sub>3</sub>		4.14
4	H	H	H		3.90

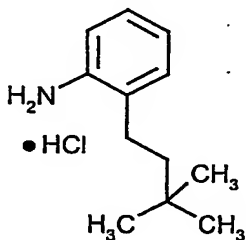
Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	logP
5	H	H	CH <sub>3</sub>		4.13
6	H	H	H		3.87
7	H	H	CH <sub>3</sub>		4.15
8	H	H	H		3.78
9	H	H	H		3.76
10	H	H	H		3.68
11	H	H	CH <sub>3</sub>		3.28
12	H	H	CH <sub>3</sub>		3.91
13	H	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		4.96
14	H	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		5.02

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (III)Beispiel (III-1)

- 5 Eine Lösung bestehend aus 8.0 g (0.045 mol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on (X-1), 6.8 g (0.135 mol) Hydrazin-hydrat und 7.6 g (0.135 mol) Kaliumhydroxid in 90 ml Triethylenglycol wird für 6 h auf 210°C erhitzt. Zur Aufarbeitung wird bei Raumtemperatur Wasser und Essigsäureethyl-ester zugegeben. Die organische Phase wird erneut mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck aufkonzentriert. Reinigung durch Säulenchromatographie
- 10 (Cyclohexan/Essigsäureethylester 3:1) liefert 5.3 g (71.5 % der Theorie) an [2-(3-Methylbutyl)-phenyl]amin.

Beispiel (III-2)

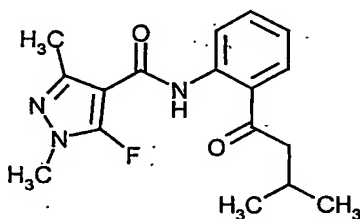
- 15 3.23 g (15 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-ynyl)-phenyl]-acetamid (XIII-1) wurden in 40 ml Methanol vorgelegt. Man gibt 0.5 g Palladium-Kohle (5 %) zu und hydriert anschließend im Autoklaven 20 h bei 4 bar Wasserstoffdruck. Nach Abtrennung des Katalysators und Entfernung des Lösungsmittels erhielt man 3.1 g (94 % der Theorie) an N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 2.69.

Beispiel (III-3)

0.5 g (2.3 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid (III-2) wurden in 20 ml 2N Salzsäure 5 h bei 100°C gerührt. Nach dem Abkühlen wurde 3 mal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingengt. Man erhielt 390 mg (79 % der Theorie) an 2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenylamin-Hydrochlorid mit dem logP (pH 2.3) = 2.20.

### Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (V)

#### Beispiel (V-1)



10

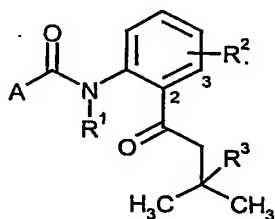
Bei Raumtemperatur werden 355.0 mg (2.0 mmol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonylchlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran gegeben. Die Reaktionsmischung wird für 1.5 h bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigester : 3/1) liefert 577.7 mg (1.8 mmol, 88 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure-[2-(3-methyl-butyl)-phenyl]-amid mit dem logP (pH = 2.3) = 3.42.

15

20

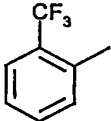
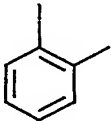
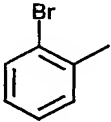
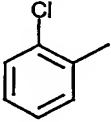
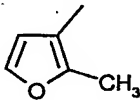
Analog Beispiel (V-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 2 genannten Verbindungen der Formel (V) erhalten.

Tabelle 2



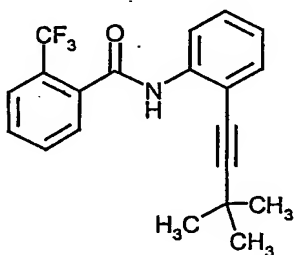
(V)

Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	logP
V-2	H	H	H		4.30

Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	logP
V-3	H	H	H		4.33
V-4	H	H	H		4.53
V-5	H	H	H		4.35
V-6	H	H	H		4.30
V-7	H	H	H		4.44

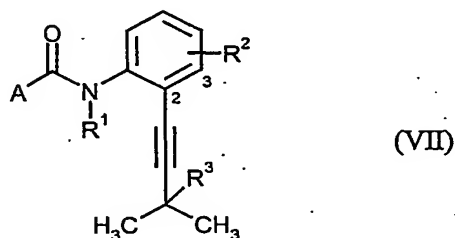
### Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (VII)

#### 5 Beispiel (VII-1)



190 mg (1.0 mmol) 2-Trifluormethylbenzoesäure, 178 mg (0.83 mmol) 2-(3,3-Dimethyl-but-1-ynyl)-phenylamin, 215 mg (1.67 mmol) N,N-Diisopropylethylamin und 583 mg (1.25 mmol) PyBrOP wurden in 8 ml Acetonitril 4 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Das Gemisch wurde mit 10 ml Essigsäureethylester/Wasser 1:1 versetzt, die organische Phase abgetrennt und mit 10 ml gesättigter Ammoniumchlorid-Lösung und anschließend mit 10 ml Wasser gewaschen. Abtrennen, Einengen und Trocknen der organischen Phase lieferte 950 mg Rohprodukt. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Petrolether/Essigsäureethylester 10:1 → Essigsäureethylester) wurden 110 mg N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-ynyl)-phenyl]-2-trifluoromethyl-benzamid erhalten [logP (pH 2.3) = 4.55].

Analog Beispiel (VII-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 3 genannten Verbindungen der Formel (VII) erhalten.

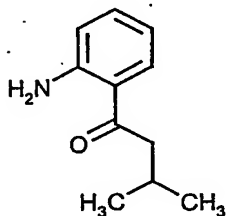
5 Tabelle 3

Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	logP
VII-2	H	H	CH <sub>3</sub>		4.73
VII-3	H	H	CH <sub>3</sub>		3.75
VII-4	H	H	CH <sub>3</sub>		4.52
VII-5	H	H	CH <sub>3</sub>		4.17

### Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (X)

10

#### Beispiel (X-1)



15

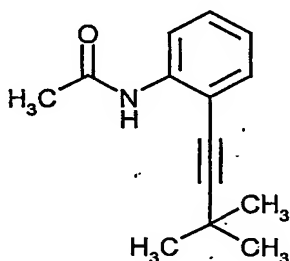
Eine Lösung aus 29.5 g (0.25 mol) Antranilsäurenitril in 150 ml Tetrahydrofuran wird bei Rückfluss zu einer Suspension bestehend aus 18.2 g (0.75 mol) Magnesium, 375 ml einer 2 M Lösung von Isobutylmagnesiumbromid in Tetrahydrofuran und 15 ml Diethylether getropft. Nach 5 h Erhitzen



unter Rückfluss wird die Reaktionsmischung bei 0°C mit 100 ml Wasser versetzt, und der pH-Wert mit Salzsäure auf 6 eingestellt. Die organische Phase wird mit Wasser gewaschen und über Magnesiumsulfat getrocknet. Aufkonzentration im Vakuum und Reinigung an Kieselgel (Eluent: Petrolether/Aceton 95:5) liefert 11.0 g (25 % der Theorie) an 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on mit dem logP (pH 2.3) = 2.89..

### Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (XIII)

#### 10 Beispiel (XIII-1)



25.7 g (120 mmol) ortho-Bromacetanilid, 5.05 g (7.2 mmol) Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid und 1.37 g (7.2 mmol) Kupfer(I)iodid wurden in 450 ml Triethylamin unter Argon vorgelegt. Anschließend wurde bei Raumtemperatur innerhalb von 10 min. 17.8 g (180 mmol) 3,3-Dimethyl-1-butin zugetropft und 5 h bei 50°C gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf 2 l Wasser gegossen, 3 mal mit je 250 ml Diethylether extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und eingengt. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 mit Methylenchlorid erhält man 25.9 g an N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-ynyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.03.

20 Die Bestimmung der in den voranstehenden Tabellen und Herstellungsbeispielen angegebenen logP-Werte erfolgt gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1 % wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

25 Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele:Beispiel A5 **Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv**

Lösungsmittel:      24,5    Gewichtsteile Aceton  
                         24,5    Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator :            1      Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

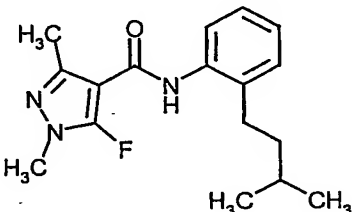
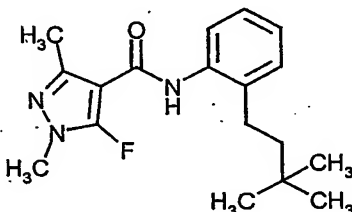
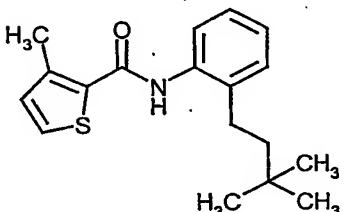
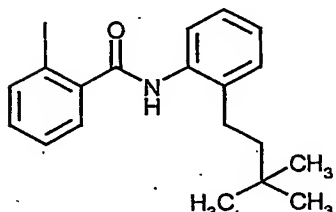
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauenerregers *Podosphaera leucotricha* inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

20

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle A

## Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	100
	100	100
	100	99
	100	97

Beispiel B

**Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

- 5    Lösungsmittel:        24,5    Gewichtsteile Aceton  
                              24,5    Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator :                1        Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

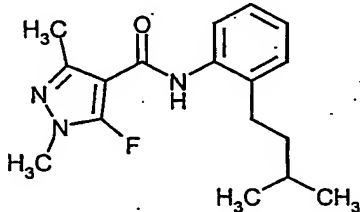
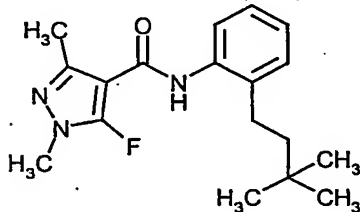
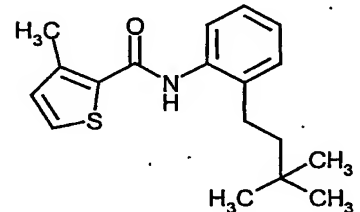
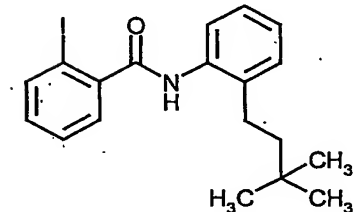
10    Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15    Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

Tabelle B

## Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	96
	100	100
	100	99
	100	97

Beispiel C

**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

- 5   Lösungsmittel:       24,5   Gewichtsteile Aceton  
                          24,5   Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator :           1    Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykoether

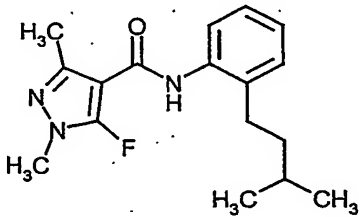
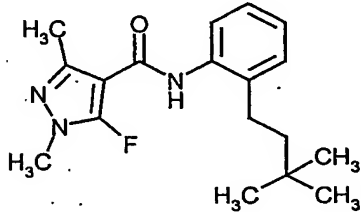
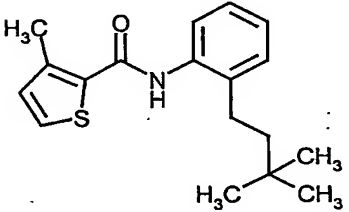
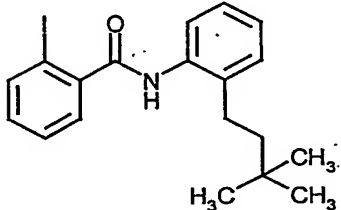
10   Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15   Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

20   2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle C

## Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	84
	500	100
	500	100
	500	87

Beispiel D

**Puccinia-Test (Weizen) / kurativ**

- 5    Lösungsmittel:            50    Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid  
    Emulgator:              1    Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit

- 10   Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- Zur Prüfung auf kurative Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine. Anschließend werden die Pflanzen mit der  
15   Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht.

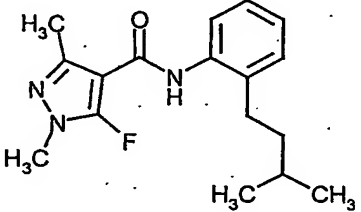
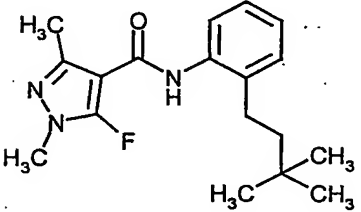
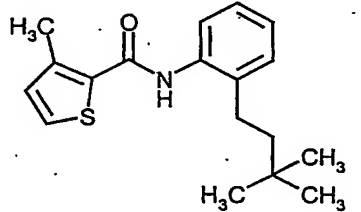
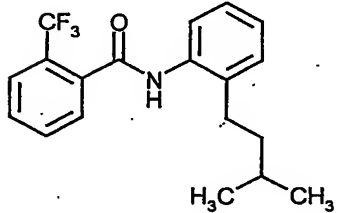
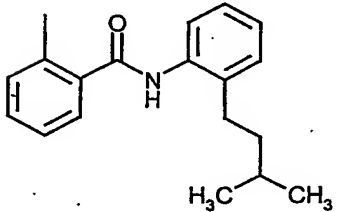
Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

- 20   8 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.



Tabelle D

## Puccinia-Test (Weizen) / kurativ

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel E

**Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

- 5    Lösungsmittel:            49    Gewichtsteile N, N-Dimethylformamid  
      Emulgator:            1    Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

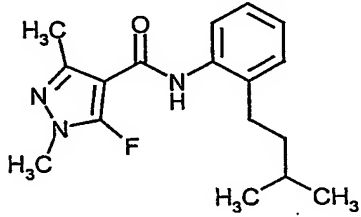
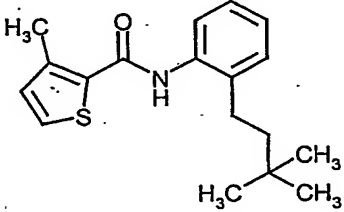
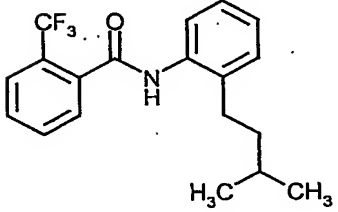
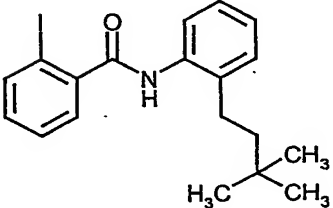
      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit  
10    Wasser auf die gewünschte Konzentration.

      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in  
15    einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

      7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

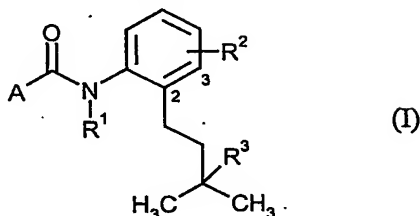
Tabelle E

## Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	750	100
	750	100
	750	100
	750	100

Patentansprüche

## 1. Isopentylcarboxanilide der Formel (I)



5 in welcher

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>4</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen

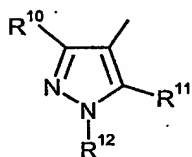
bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>9</sup> enthalten kann,

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>9</sup> enthalten kann,

R<sup>9</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R<sup>10</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,

R<sup>11</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und

R<sup>12</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht, mit der Maßgabe, dass R<sup>10</sup> nicht für Iod steht, wenn R<sup>11</sup> für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R<sup>10</sup> nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R<sup>3</sup> und R<sup>11</sup> für Wasserstoff und R<sup>12</sup> für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A2)

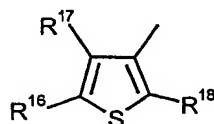


(A2) steht, in welcher

$R^{13}$  und  $R^{14}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen und  
 $R^{15}$  für Halogen, Cyano oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A3)



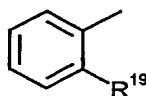
(A3) steht, in welcher

$R^{16}$  und  $R^{17}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und  
 $R^{18}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

10

oder

A für den Rest der Formel (A4)



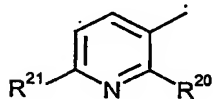
(A4) steht, in welcher

$R^{19}$  für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15

oder

A für den Rest der Formel (A5)



(A5) steht, in welcher

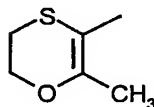
$R^{20}$  für Halogen, Hydroxy, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{21}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl steht,

25

oder

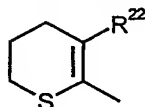
A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

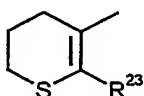


(A7) steht, in welcher

R<sup>22</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

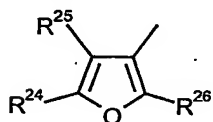


(A8) steht, in welcher

R<sup>23</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht, in welcher

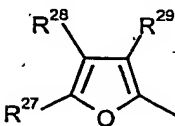
R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R<sup>26</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R<sup>24</sup> und R<sup>26</sup> nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R<sup>25</sup> für Wasserstoff steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



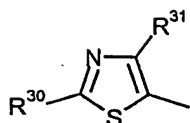
(A10) steht, in welcher

R<sup>27</sup> und R<sup>28</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R<sup>29</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

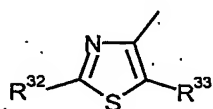
$R^{30}$  für Wasserstoff, Halogen, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino, Di-( $C_1$ - $C_4$ -alkyl)-amino, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{31}$  für Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass  $R^{31}$  nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn  $R^3$  für Wasserstoff und  $R^{30}$  für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



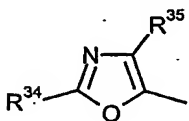
(A12) steht, in welcher

$R^{32}$  für Wasserstoff, Halogen, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino, Di-( $C_1$ - $C_4$ -alkyl)-amino, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

$R^{33}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)



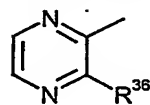
(A13) steht, in welcher

$R^{34}$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht und

$R^{35}$  für Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



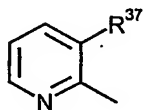
(A14) steht, in welcher

$R^{36}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder



A für den Rest der Formel (A15)

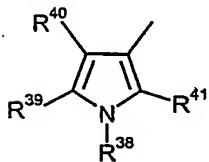


(A15) steht, in welcher

$R^{37}$  für Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)



(A16) steht, in welcher

$R^{38}$  für Wasserstoff, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl, Hydroxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl, Di( $C_1$ - $C_4$ -alkyl)aminosulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

$R^{39}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

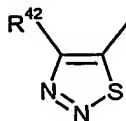
$R^{40}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

$R^{41}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass  $R^{40}$  nicht für Trifluormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

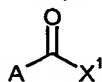


(A17) steht, in welcher

$R^{42}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht.

2. Verfahren zum Herstellen der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



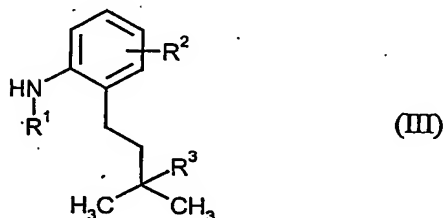
(II),

in welcher

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und  
 $X^1$  für Halogen oder Hydroxy steht,

5

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)



in welcher

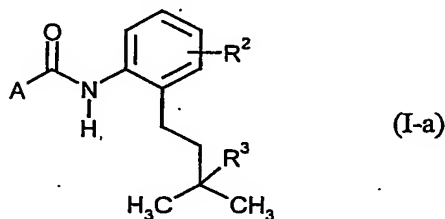
$R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

b) Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)



15

in welcher

A,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben

mit Halogeniden der Formel (IV)



in welcher

$X^2$  für Chlor, Brom oder Iod steht,

$R^{1A}$  für  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, ( $C_1$ - $C_3$ -Alkyl)-

25

carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

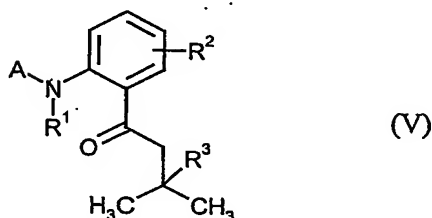
(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>4</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> steht,

wobei R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

c) Isopenten-Derivate der Formel (V)



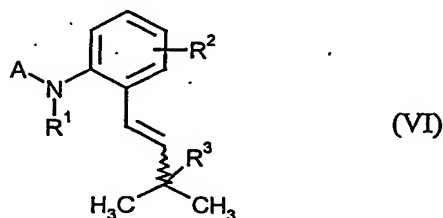
in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)

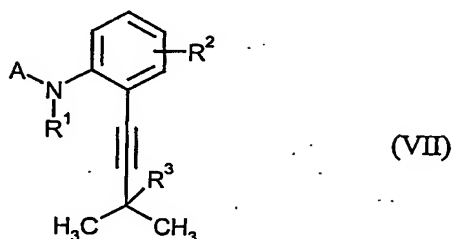


in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

## e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)



in welcher  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

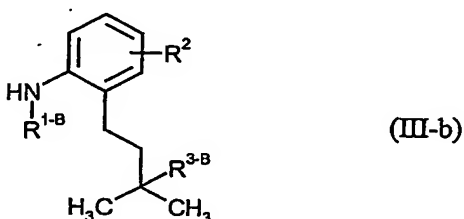
3. Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Isopentylcarboxanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

4. Verwendung von Pyrazolylcarboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

5. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

6. Verfahren zum Herstellen von Mitteln zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

## 7. Anilin-Derivate der Formel (III-b)



in welcher

a)  $R^{1-B}$  für  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ -

C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>4</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> steht, und

R<sup>3-B</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht,

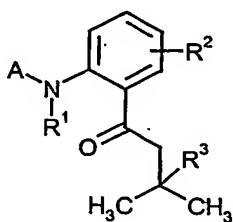
oder

b) R<sup>1-B</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>4</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> steht, und

R<sup>3-B</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht,

und R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> jeweils die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

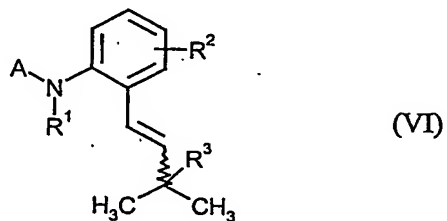
#### 8. Isopenton-Derivate der Formel (V)



(V)

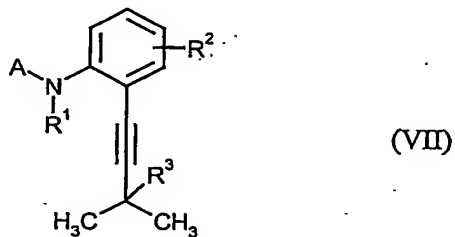
in welcher  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

9. Isopenten-Derivate der Formel (VI)



5 in welcher  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

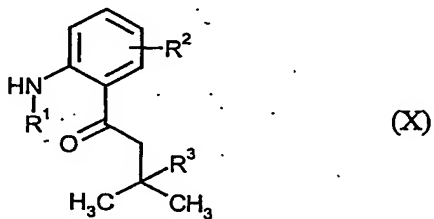
10. Isopentin-Derivate der Formel (VII)



in welcher

10  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,  
A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen mit Ausnahme von A1 hat.

11. Alkanonäniline der Formel (X)

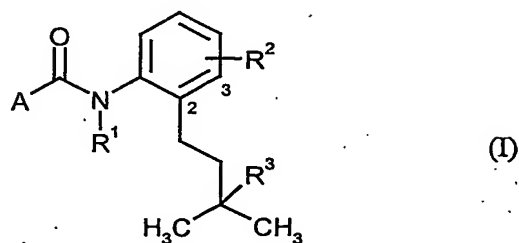


15 in welcher  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

Isopentylcarboxanilide

## Zusammenfassung

Neue Isopentylcarboxanilide der Formel (I)



in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

mehrere Verfahren zum Herstellen dieser Stoffe und deren Verwendung zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.